

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年4月28日 (28.04.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/037269 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 31/275, 31/165, 31/216, 31/137, 31/18, 31/505, 31/166, 31/4545, 31/506, 31/454, 31/4535, 31/423, 31/496, 31/439, 31/381, 31/4406, 31/4402, 31/429, 31/4453, 31/495, 31/5375, 31/47, 31/4196, 31/343, 31/341, 31/55, 31/36, 31/417, 31/4164, 31/4196, C07C 311/20, 311/07, 255/46, 311/39, 311/21, 229/48, 217/52, 311/05, 311/18, 233/05, 233/78, 237/24, 323/36, 317/32, 309/46, C07D 207/38, 209/04, 211/14, 239/42, 401/04, 401/14, 403/06, 413/04, 417/04, 409/04, 263/58, 277/82, 451/02, 333/20, 231/38, 233/88, 213/36, 513/04, 295/22, 295/14, 215/38, 249/08, 307/79, 307/82, 223/06, 223/04, 317/58, A61P 3/06, 9/00, 9/10, 7/02, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/015773

(22) 国際出願日: 2004年10月19日 (19.10.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願 2003-361256  
2003年10月21日 (21.10.2003) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 住友製薬  
株式会社 (SUMITOMO PHARMACEUTICALS CO.,LTD.) [JP/JP]; 〒5418510 大阪府大阪市中央区道修町  
2丁目2番8号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 坂 仁志 (BAN, Hitoshi) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 大沼 聰 (OHNUMA, Satoshi) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 坪谷 典枝 (TSUBOYA, Norie) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 浅野 成宏 (ASANO, Shigehiro) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP).

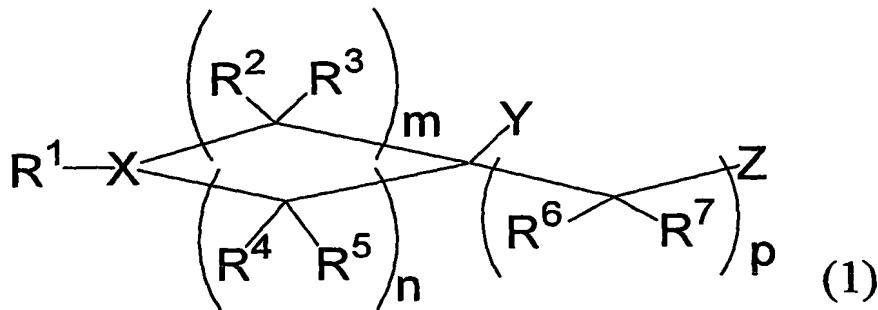
(74) 代理人: 五十部 穣 (ISOBE, Yutaka); 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社 知的財産部内 Osaka (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,

/統葉有/

(54) Title: NOVEL PIPERIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規ピペリジン誘導体



(57) Abstract: A compound represented by the following formula (1), a prodrug thereof, or a pharmaceutically acceptable salt of either. They are effective in enhancing LDL receptor manifestation and are useful as a therapeutic agent for hyperlipidemia, arteriosclerosis, etc. (1) (In the formula, m, n, and p each independently is an integer of 0 to 4, provided that  $3 \leq m+n \leq 8$ ; X represents nitrogen or a group represented by C-R<sup>15</sup>; Y represents an (un)substituted aromatic group; R<sup>15</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, and R<sup>7</sup> each represents hydrogen, (un)substituted alkyl, etc.; and Z represents hydrogen, cyano, etc.)

(57) 要約: LDL受容体発現増強作用を有し、高脂血症や動脈硬化等の治療剤として有用な、下記式(1)で表される化合物もしくはそのプロドラッグ、またはそれらの薬学上許容される塩を提供する。[式中、m、n、及びpは独立して0~4の整数を表すが、 $3 \leq m+n \leq 8$ である。Xは窒素原子または式: C-R<sup>15</sup>で表される基を、Yは置換もしくは無置換の芳香族基等を、R<sup>15</sup>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、およびR<sup>7</sup>は、水素原子、置換もしくは無置換のアルキル基等を、Zは、水素原子、シアノ基等を表す。]

WO 2005/037269 A1



LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,

IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。